11 Veröffentlichungsnummer:

0 012 428 A1

12

EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

21 Anmeldenummer: 79105108.9

2 Anmeldetag: 12.12.79

(a) Int. Cl.³: **C 07 C 125/08**, C 07 C 155/02, C 07 D 307/68, C 07 D 333/38,

A 01 N 47/40

30 Priorität: 18.12.78 DE 2854600

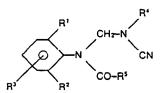
(7) Anmelder: BASF Aktlengesellschaft, Carl-Bosch-Strasse 38, D-6700 Ludwigshafen (DE)

 Veröffentlichungstag der Anmeldung: 25.06.80 Patentblatt 80/13

Benannte Vertragsstaaten: AT BE CH DE FR GB IT LU NL SE © Erfinder: Eicken, Karl, Dr. Dipl.-Chem., Waldstrasse 63, D-6706 Wachenheim (DE)
Erfinder: Plath, Peter, Dr. Dipl.-Chem., Berner Weg 24, D-6700 Ludwigshafen (DE)
Erfinder: Pommer, Ernst-Helnrich, Dr., Berliner Platz 7, D-6703 Limburgerhof (DE)

Substituierte Cyanamide, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Fungizide.

5 Substituierte Cyanamide der allgemeinen Formel



und ein Schwefelatom enthält, R⁵ ferner ein Phenyl oder ein durch ein bis drei gleiche oder verschiedene Substituenten aus der Gruppe Fluor, Chlor, Brom, Trifluormethyl, Cyan, Nitro, C1-C4-Alkyl, C1-C4-Alkoxy substituiertes Phenyl bedeutet.

2

in welcher

R1 C1-C4-Alkyl oder C1-C4-Alkoxy,

R2 Wasserstoff, C1-C4-Alkyl, C1-C4-Alkoxy oder Halogen,

R3 Wasserstoff, C1-C4-Alkyl oder Halogen,

R⁴ CI-C₄-Alkoxcarbonyl, C₃-C₄-Alkenoxycarbonyl, C₁-C₄-Alkyl-thiocarbonyl oder Cyan und

R⁵ ein gegebenenfalls durch niederes Alkoxy, Alkylthio, Cyan oder Halogen substituiertes C₁-C₆-Alkyl, ein gegebenenfalls durch

Halogen substituiertes C2-C3-Alkenyl, ein C2-C4-Alkinyl, ein C3C7-Cycloalkyl, einen gegebenenfalls durch niederes Alkyl oder Halogen substituierten heterocyclischen Rest bedeutet, der ein Sauerstoffatom oder ein Schwefelatom oder ein Stickstoffatome und ein Sauerstoffatom oder bis zu zwei Stickstoffatome und ein Sauerstoffatom oder bis zu zwei Stickstoffatome

Ш

BASF Aktiengesellschaft

0. Z. 0050/033581

Substituierte Cyanamide, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Fungizide

Die vorliegende Erfindung betrifft neue wertvolle substi-5 tuierte Cyanamide, Verfahren zu ihrer Herstellung sowie Fungizide, die diese Verbindungen enthalten.

Es ist bereits bekannt, daß Cyanacetamid-Derivate z.B. das 2-Cyano-N-(äthylaminocarbonyl)-2-methoxy-iminoacetamid eine fungizide Wirkung gegenüber niederen Pilzen hat (US-PS 3 954 992). Es ist ferner bekannt, das N-Trichlormethylthio-tetrahydrophthalimid zur Bekämpfung von Pilzen zu verwenden (Chemical Week, June 21, 1972, Seite 46).

Es wurde gefunden, daß substituierte Cyanamide der Formel

20

in welcher

R¹ C₁-C₄ Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy,
R² Wasserstoff, C₁-C₄ Alkyl, C₁-C₄ Alkoxy oder Halogen, R³ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder Halogen,

Sws/ro

Phenyl bedeutet.

TR⁴ C₁-C₆-Alkoxcarbonyl, C₃-C₄-Alkenoxycarbonyl, C₁-C₆-Alkyl-thiocarbonyl oder Cyan und

R⁵ ein gegebenenfalls durch niederes Alkoxy, Alkylthio, Cyan oder Halogen substituiertes C₁-C₆ Alkyl, ein gegebenenfalls durch

Halogen substituiertes C_2 - C_5 Alkenyl, ein C_2 - C_4 Alkinyl, ein C_3 - C_7 Cycloalkyl, einen gegebenenfalls durch niederes Alkyl oder Halogen substituierten heterocyclischen Rest bedeutet, der ein Sauerstoffatom oder ein Schwefelatom oder ein Stickstoffatom oder bis zu zwei Stickstoffatome und ein Sauerstoffatom oder bis zu zwei Stickstoffatome und ein Schwefelatom enthält, R^5 ferner ein Phenyl oder ein durch ein bis drei gleiche oder verschiedene Substituenten aus der Gruppe Fluor, Chlor, Brom, Trifluormethyl, Cyan, Nitro, C_1 - C_4 -Alkyl, C_4 - C_4 Alkoxy substituiertes

eine gute fungizide Wirkung gegenüber phytopathogenen Pilzen haben.

20

5

10

15

Es wurde ferner gefunden, daß man substituierte Cyanamide erhält, wenn man ein N-Halogenmethylanilid der Formel

$$\begin{array}{c|c}
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\$$

in welcher R¹, R², R³ und R⁵ die oben angegebene Bedeutung haben und Hal Halogen, insbesondere Chlor oder Brom bedeutet, mit einem Cyanamid der Formel

· 3: -

O.Z. 0050/033531



in welcher R⁴ die oben angegebene Bedeutung hat und M Wasserstoff, ein Alkalimetall oder einen Tetraalkylammonium-Rest bedeutet, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines gegenüber den Reaktionspartnern inerten Lösungsmittels umsetzt.

Unter Alkyl und Alkylrest einer Alkoxygruppe bei den Resten R¹, R², R³, R⁴ und R⁵ sind je nach Zahl der genannten Kohlenstoffatome beispielsweise folgende Gruppen zu verstehen: Methyl, Äthyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-, iso-, sec.- oder tert.-Butyl, Pentyl oder Hexyl und ihre Isomeren.

- Als Alkenyl sind vor allem beispielsweise Vinyl, Allyl,
 Methallyl und Pentenyle zu nennen. Als C₂ bis C₄-Alkinyl
 sind vor allem beispielsweise Äthinyl, Propargyl und
 But-2-inyl zu erwähnen.
- Als Cycloalkyl ist vor allem beispielsweise Cyclopropyl,
 Cyclobutyl, Cyclopentyl und Cyclohexyl zu nennen.

Unter Halogen sind beispielsweise Fluor, Chlor oder Brom zu verstehen.

Als heterocyclischer Rest in der Bedeutung für R⁵ sind vorzugsweise 5- bis 6-gliedrige Reste zu nennen beispiels-weise Furan, Thiophen, Oxazol, Isoxazol, Thiazol, Oxadiazol, Thiodiazol, Tetrahydrofuran, 2,3-Dihydropyran oder Pyridin, welche gegebenenfalls durch Methyl und/oder Halogen substituiert sein können.

0.Z. 0050/033581

Als substituiertes Phenyl für R⁵ gelten vor allem beispielsweise mono-substituierte Phenyle wie Fluorphenyl, Chlorphenyl, Bromphenyl, Trifluormethylphenyl, Tolyl, Anisyl, Nitrophenyl; ferner disubstituierte Phenyle wie Dichlorphenyl, Difluorphenyl, Fluorchlorphenyl, Dimethylphenyl, Dimethoxyphenyl, Methylfluorphenyl, Methylchlorphenyl, Methylbromphenyl, Methylfluorphenyl, Methyltrifluormethylphenyl, Chlortrifluormethylphenyl.

Die Umsetzungen können in Anwesenheit oder Abwesenheit von Lösungsmitteln durchgeführt werden, gegenüber denen die Reaktionspartner inert sind. Als Lösungsmittel kommen z.B. aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, Xylol; halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Chlorbenzol, Chloroform, Methylenchlorid, Methylchlorid; Ather wie Tetrahydrofuran, Dioxan; Nitrile wie Acetonitril; N,N-Dialkylamide wie Dimethylformamid; Sulfone wie Dimethylsulfoxid; Ketone wie Aceton; aliphatische Ester wie Essigsäureester und Gemische dieser Lösungsmittel in Frage. Die Reaktionstemperaturen liegen zwischen 0° und 150°C, vorzugsweise zwischen 20° und 100°C.

Setzt man Cyanamide der Formel III um, in der M die Bedeutung von Wasserstoff hat, dann ist die Verwendung von säurebindenden Mitteln vorteilhaft. Als solche kommen tertiäre Amine z.B. Triäthylamin, Pyridin und substituierte Pyridine oder anorganische Basen, z.B. Oxide und Hydroxide, Carbonate und Hydrogencarbonate von Alkalimetallen in Betracht.

30

Es wurde ferner eine besondere Ausführungsform für die Herstellung der Cyanamid-Verbindungen der allgemeinen Formel I gefunden, wobei man ein N-Halogenmethylanilid der Formel

5

10

O.Z. 0050/033581

$$R^3$$
 R^2
 CH_2 -Hal
 $CO-R^5$

in welcher R¹, R², R³ und R⁵ die oben angegebene Bedeutung haben und Hal Chlor oder Brom bedeutet, mit einem Cyanamid der Formel

in welcher R⁴ die oben angegebene Bedeutung hat und M
ein Alkalimetall bedeutet, in einem Zweiphasensystem,
wobei die eine Phase Wasser und die andere Phase ein
mit der wäßrigen Phase nicht mischbares gegenüber den
Reaktionspartnern inertes Lösungsmittel ist, in Gegenwart eines Phasentransferkatalysators umsetzt. Gegebenenfalls kann die Umsetzung auch in einem Zweiphasensystem in Gegenwart eines Phasentransferkatalysators ohne
Zusatz von Wasser durchgeführt werden, wobei das Cyanamid der Formel III, in dem mit Wasser nicht mischbaren
25 Lösungsmittel suspendiert wird.

Das mit Wasser nicht mischbare Lösungsmittel, ist vorzugs-weise ein aromatischer Kohlenwasserstoff oder ein halogenierter Kohlenwasserstoff. Der Phasentransferkatalysator liegt beispielsweise in Mengen von 0,5 bis 30 Molprozent bezogen auf eingesetztes N-Halogenmethylanilid der Formel II vor.

Die Reaktion wird bei 0°C bis 100°C, vorzugsweise 10 bis 50°C vorgenommen.

- **0. Z.** 0050/033581

TAls Phasentransferkatalysatoren kommen Oniumverbindungen z.B. quaternäre Ammoniumverbindungen oder Phosphoniumverbindungen oder makrocyclische Polyäther in Frage. Quaternäre Ammoniumverbindungen sind z.B. Tetrabutylammoniumhydrogensulfat, Tetrapentylammoniumchlorid, 5 Tetraoctylammoniumchlorid, Tripropylbutylammoniumchlorid, Tricaprylyl-methylammoniumchlorid, Hexadecyl-trimethylammoniumchlorid, Distearyl-dimethylammoniumchlorid, Dibenzyldimethylammonium-methylsulfat, Dimethyldodecyl-benzyl--ammoniumchlorid, Benzyltrimethylammoniumchlorid, Benzyl-10 -triäthylammoniumchlorid, 2-Hydroxy-äthyltrimethylammoniumchlorid, beispielsweise quaternäre Phosphoniumverbindungen, z.B. Tributyl-methylphosphoniumbromid, Hexadecyl-tributylphosphoniumbromid, Äthyl-triphenyl-phosphoniumbromid, Tetraphenylphosphoniumbromid oder die entsprechenden Hy-15 droxide dieser Onium-Verbindungen.

Makrocyclische Polyäther sind z.B. 15-Krone-5, 18-Krone-6, Dibenzo-18-krone-6, Dicyclohexyl-18-krone-6 (Kronenäther).

Zur Herstellung der neuen Verbindungen setzt man auf 1 Mol N-Halogenmethylanilid der Formel II mindestens 1 Mol Cyanamid der Formel III ein.

Zur Isolierung der Verbindungen der Formel I wird beispiels-weise, gegebenenfalls nach Abfiltrieren des entstandenen Halogenids, das Filtrat eingedampft und der Rückstand in einem organischen mit Wasser nicht mischbaren Lösungsmittel gelöst. Dann wird die organische Phase mit Wasser gewaschen, getrocknet und danach im Vakuum eingeengt. Das erhaltene Produkt der Formel I ist in vielen Fällen rein, wenn nötig kann es durch Umkristallisation oder Chromatographie beispielsweise an Kieselgel weiter gereinigt werden.

35

5

0. Z: 0050/053531

Bei dem zweiphasigen Herstellungsverfahren wird nach Ende der Umsetzung die organische Phase abgetrennt bzw. von Ungelöstem abfiltriert, mit Wasser gewaschen, getrocknet und wie oben beschrieben der Wirkstoff der Formel I isoliert.

Die als Ausgangsverbindungen verwendeten N-Halogenmethylanilide sind teilweise bekannt (US-PS 3 637 847) oder können in an sich bekannter Weise durch Umsetzung von entsprechend substituierten Phenylazomethinen mit Säure-10 chloriden der Formel R⁵-CO-Hal hergestellt werden, wobei R⁵ die oben genannten Bedeutungen hat und Hal Halogen bedeutet.

Cyanamid-Verbindungen der Formel III sind bekannte Verbindungen, beispielsweise: Cyancarbaminsäureester (DE-PS 24 74 453, DE-OS 17 95 849) Cyancarbaminsäurethiolester (Yuki Cosei Kagaku Kyokai Shi 1971, 29 (1) 67 (CA: 74, 140877 u)) und Dicyanimid (Liebigs Ann. Chem. 427, 1 1922; J. Chem. Soc. C, 1970, 875). 20

Als Beispiele für die als Ausgangsprodukte geeigneten Cyanamid-Verbindungen sowie deren Salze seien im einzelnen genannt:

Cyancarbaminsäuremethylester oder dessen Natrium-, Kalium- oder Tetramethylammoniumsalze Cyancarbaminsäureäthylester oder dessen Natrium-, Kaliumoder Tetramethylammoniumsalz,

Cyancarbaminsäure-n-propylester oder dessen Natrium-, 30 Kalium- oder Tetramethylammoniumsalz, Cyancarbaminsäure-isopropylester oder dessen Natriumoder Kaliumsalz, Cyancarbaminsäure-n-butylester oder dessen Natrium- oder

35 Kaliumsalz,

10

15

0. Z. 0050/053531

Cyancarbaminsäure-sec.-butylester oder dessen Natrium-oder Kaliumsalz,

Cyancarbaminsäure-n-hexylester oder dessen Natrium- oder Kaliumsalz,

5 Cyancarbaminsäure-methylthiolester oder dessen Natrium-, Kalium- oder Tetramethylammoniumsalz, Cyancarbaminsäure-äthylthiolester oder dessen Natrium-,

Cyancarbamınsaure-athylthiolester oder dessen Natrium-, Kalium- oder Tetraäthylammoniumsalz,

Cyancarbaminsaure-n-propylthiolester oder dessen Natriumoder Kaliumsalz.

Cyancarbaminsäure-isopropylthiolester oder dessen Natrium- oder Kaliumsalz.

Dicyanimid, insbesondere dessen Natrium-, Kalium- oder Tetramethylammoniumsalz.

Die folgenden Beispiele erläutern die Herstellung der neuen Cyanamid-Verbindungen der Formel I sowie die Herstellung der Ausgangsmaterialien der Formel II.

20 In den Beispielen verhalten sich Gewichtsteile zu Volumenteilen wie Kilogramm zu Liter.

Beispiel a

- 25 315 Raumteile einer Toluol-Lösung, die 1 Mol 2,6-Dimethylphenylazomethin enthält, (US-PS 3 637 847) wurden unter
 Rühren bei 5-10°C zu einer Lösung von 130,5 Gewichtsteilen2-Furancarbonsäurechlorid in 100 Raumteilen Toluol unter
 Kühlung zugetropft und anschließend 10 Stdn. bei Raumtem-
- peratur gerührt. Nach dem Kühlen, Absaugen und Trocknen im Vakuum erhielt man 198 Gewichtsteile N-Chlormethylfuran-2-carbonsäure-2',6'-dimethylanilid vom Schmelzpunkt 124 bis 126°C.
- In analoger Weise können folgende N-Halogenmethylanilide der Formel II hergestellt werden:

- 9 -

0. Z. 0050/033581

	R ¹	R ²	R ³	Hal	R ⁵	Fp. °C
	CH ₃	CH ₃	Н	Cl	CH ₃	feste Masse
	CH ₃	с ₂ н์ ₅	H	Cl	сн ₃	feste Masse
10	C ₂ H ₅	. C ₂ H ₅	Н	Cl	CH ₃	Öl
	CH ₃	CH 3	H	Cl	C2H5	٥ı
	CH ₃	с ₂ н์ ₅	H	Cl	с ₂ н ₅	٥ı
		C ₂ H ₅		Cl	c ₂ H ₅	Öl
		CH ₃		Cl	сн(сн ₃) ₂	
15		с ₂ н ₅		Cl	CH(CH ₃) ₂	•
		C ₂ H ₅		Cl	CH(CH ₃) ₂	75 - 76
			H	Cl		Öl
	CH ₃	CH ₃	H	Cl	сн(сі)сн ₃	95 ⁰
	с ₂ н ₅	CH ₃	H	Cl	CH(C1)CH3	
20	C ₂ H ₅	c ₂ H ₅	H	Cl	CH(Cl)CH ₃	
	CH ₃	CH ₃		Cl	CH(CI)CH ²	
	CH ₃	^C 2 ^H 5	Н	Cl	сн ₂ -сн ₂ сі́	zähes Öl
	CH ₃	CH ₃	H	Cl	CH2-CH2CI	
	CH ₃	CH ₃	Н	Cl	CH2-CH2-CH2CI	
25	CH ₃	CH ₃	H	Cl	CHC12	102-104
	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl		
	CH ₃	с ₂ н ₅	Н	Cl	CHC12	88-90
	CH ₃	CH ₃	H	Cl	cci ³	٥ı
	CH ₃	CH ₃	Н	Cl	сн=с́н ₂	
30	CH ₃	CH ₃	H	Cl		
	CH ₃	CH ₃	Н	Cl	с=сн ₂ сн ₃	91-92
	CH ₃	CH ₃	Н	Cl	c=cH ₂	
25						

	'R ¹	R ²	R ³	Hal	R ⁵	Fp. °C	٦
	CH ₃	CH ₃	Н	Cl	CH=CCl ₂	 	
	CH ₃	CH ₃	H	Cl	cc1=cc1 ²		
5	CH ₃	CH ₃	Н	Cl		82	
	CH ₃	с ₂ н ₅	H	Cl	\triangleleft	٥ı	
	C2H5	c ₂ H ₅	Н	Cl	\triangleleft	٥ı	
10	CH ₃	CH ₃	Н	Cl			
	CH ₃	CH ₃	Н	Cl	$\langle H \rangle$		
	CH ₃	с ₂ н ₅	Н	Cl	$\langle H \rangle$		
15	^с 2 ^н 5	^C 2 ^H 5	Н	Cl	H	97-100	
	CH ₃	CH ₃	H	Cl	сн ₂ осн ₃	70°	
	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl	CH ₂ OCH ₃		
20	сн ₃ с ₂ н ₅	°2"5 °2 ^H 5	H H	C1 C1	CH ₂ OCH ₃	8.	
	CH ₃	CH 3	Н	Cl	CH ₂ OCH ₃ CH ₂ SCH ₃	Öl Kristallm	
	CH ₃	C ₂ H ₅	Н	Cl	CH ₂ SCH ₃	127	asse
	С ₂ Н ₅	C ₂ H ₅	H	C1	CH ₂ SCH ₃	Öl	
25	CH ₃	CH ₃	Н	Cl	CH2-CN		
	CH ₃	CH ₃	Н	Cl	\bigcirc	133	
	CH ₃	с ₂ н ₅	H	Cl	\bigcirc		•
30	с ₂ н ₅	с ₂ н ₅	Н	Cl	\bigcirc	98- 99	
	CH ₃	снз	Н	Cl	F	86-88	

- 11 -

0012428 o.z. 0050/033581

	R ¹	R ²	R ³	Hal	R ⁵	Fp. °C
	CH ₃	CH ₃	Н	Cl	-(O) F	114-116
5	CH ₃	CH ₃	Н	Cl	- -	141-143
	сн ₃	CH ₃	Н	Cl	- (0) -	93
10	CH ₃	сн ₃	Н	Cl	- ⊘ c1	145
	CH ₃	сн ₃	Н	Cl	- (0) -c1	120
15	снз	сн ₃	H	Cl	-<0-c1	108
	^C 2 ^H 5	^C 2 ^H 5	H	Cl	- \(\frac{1}{\chi_0}\) -c1	
20	снз	снз	Н	Cl	-⊙ C1	132
25	СНЗ	CH ₃	Н .	Cl.	√O CF3	
	^C 2 ^H 5	^C 2 ^H 5	Н	Cl	-⟨O⟩ CF ₃	63-64
30	снз	CH ₃	Н	Cl	-(O)-cF ₃	108-109
- 3	^С 2 ^Н 5	сн ₃ с ₂ н ₅	Н	Cl	-O CN	112-114
35	CH ₃	CH ₃	Н	Cl	CH ₃	118-119

BNSDOCID: <EP__0012428A1_I_>

- 12 -

	-R ¹	R ²	R ³	Hal	_R 5	Fp. °C
	CH ₃	CH ₃	н	Cl	-⊘-сн ₃	119-120
5	CH ₃	CH ₃	Н	Cl	-© ocH ₃	·
10	CH ₃	CH ³	Н	Cl	-©	205–207
10	CH ₃	CH ₃	H	Cl	-© _{NO2}	152-154
15	снз	CH ₃	Н.	Cl	-⊘-NO ⁵	
13	сн3	сн ₃	Н	Cl		94-97
20	CH3	CH ₃	Н	Cl		120-121
	CH ₃	CH ³	Н	Cl		·
25	СНЗ	CH ³	Н	Ćı	C1	118
	CH ₃	сн	Н	Cl	-{>	124-126
30	CH ³	CH ₃	Н	Cl	-W-Br	
	с ₂ н ₅	с ₂ н ₅	Н	Cl	√ >	69–70
35	CH ³	CH ₃	Н	Cl	сн3сн3	68-70

0. Z.	0050/03358	3 :

	\mathbb{R}^1	R ²	R ³	Hal	R ⁵	Fp. OC
	с ⁵ н ² 2	C ₂ H ₅	Н	Cl	сн3-сн3	rp, C
:	5 ^{CH} 3	CH3	Н	Cl		•
	CH ₃	CH ₃	Н	Cl	-C"	
10	CH ³	сн3	Н	C1	CH ³	83-85
	CH3	CH3	Н	Cl	CH ³	106
15	CH ₃	-сн3	H.		√N N	,
	СН.	CH3	Н	Cl	-О-осн3	92 - 93
20	CH ₃	CH ₃	H	Cl	→OCH ³	107-08
	CH ₃	CH ₃	Н	Cl _	CF ₃	105
25	сн3	CH ³	Н	Cl	- O	118-20
30	^c 2 ^H 5	с _{2 н} 5	Н	Cl	-(O)-NO ₂	118–20
35	CH ₃ CH ₃ CH ₃ CH ₃	H CH ₃ CH ₃ CH ₃	4-C1 H H	C1 C1 C1	сн ₂ осн ₃ сн ₂ ос ₂ н ₅ сн ₂ -сн ₂ осн ₃ сн(сн ₃)осн ₃	Ö1 80-81 Ö1 Ö1

Beispiel 1

Eine Mischung aus 29,2 Gewichtsteilen N-Chlormethyl-furan-2-carbonsäure-2',6'-diäthylanilid und 13,4 Gewichtsteilen des Natriumsalzes des Cyancarbaminsäuremethylesters
in 120 Volumenteilen Acetonitril wird bei 25°C 12 Stdn.
gerührt. Nach Verdampfen des Lösungsmittels im Vakuum
wird der Rückstand in Essigester und Wasser gelöst. Die
organische Phase ergibt nach dem Trocknen, Verdampfen
des Lösungsmittels und Anreiben des Rückstandes mit Diisopropyläther 25,5 Teile N-Methoxycarbonyl-N-(N'-furyl-2-carbonyl, N'-2',6'-diäthylanilinomethyl)-cyanamid vom
Fp.: 101-103°C.

15 Beispiel 2

Zu einer Lösung von 12,2 Gewichtsteilen des Natriumsalzes des Cyancarbaminsäuremethylesters und 1 Teil Benzyl-triäthylammoniumchlorid in 30 Volumenteilen Wasser tropft
20 man bei 20 bis 25°C eine Lösung von 26,4 Gewichtsteilen N-(Chlormethyl)-furan-2-carbonsäure-2',6'-dimethylanilid in 70 Volumenteilen Methylenchlorid unter intensiver Vermischung der Phasen. Nach 6-stündiger Durchmischung wird die organische Phase abgetrennt, dreimal mit Wasser gewaschen und über Natriumsulfat getrocknet. Nach dem Verdampfen des Lösungsmittels isoliert man 29,0 Gewichtsteile N-Methoxycarbonyl-N-(N'-furyl-2-carbonyl, N'-2',6'-dimethylanilinomethyl)-cyanamid, die nach dem Umkristallisieren aus wenig Methanol einen Fp 96-98°C aufweisen.

Beispiel 3

24,1 Gewichtsteile N-Chlormethyl-benzoesäure-2,6-dimethyl-anilid werden in 100 Volumenteilen Acetonitril gelöst,
11,8 Gewichtsteile Natriumsalz des Cyancarbaminsäuremethylesters zugesetzt und die Mischung 24 Stdn. bei

Vakuum eingeengt und Rückstand mit Methylenchlorid und Wasser gelöst. Aus der organischen Phase isoliert man nach Verdampfen des Lösungsmittels und Umkristallisieren aus Methanol (100 ml) 18,0 Gewichtsteile N-Methoxycarbonyl-N--(N'-benzoyl, N'-2',6'-dimethylanilinomethyl)-cyanamid vom Fp. 136°C.

Folgende Verbindungen erhält man in entsprechender Weise:

10

5

15

20

25

30

	r	G	\mathbb{R}^1	.H ⁵ -n	R ⁴		• •
5		R3	R ²	:0-R ⁵	•		
10	Wirkstoff- Nr.	R ¹	R ²	_R 3	R ⁴	R ⁵	FD (OC) oder nD
10	1	CH ₃	CH ₃	Н	CO2CH3	CH ₃	112-114
	2	CH ₃	cH ₃	H	CO ₂ C ₂ H ₅	CH ₃	78- 80
	3	CH3	C2H5	Н	COSCH	CH ₃	
	4	CH3	cH ₃	H	CO ² CH ³	с ₂ н ₅	
15	5	CH ₃	c ₂ หี ₅	Н	CO2CH3	с ₂ н ₅	
	6	C ₂ H ₅	^C 2 ^H 5	H	со ₂ сн ₃	С ₂ H ₅	
	7	CH ₃	CH ₃	H .	CO ² CH ³	CH(CH ₃) ₂	
	8	^C 2 ^H 5	^C 2 ^H 5	H	со ² сн ³	CH(CH ₃) ₂	1,516
	9	CH ₃	CH3	Н	со ² сн ³	CH(Cl)CH ₃	100
20	10	CH ₃	^C 2 ^H 5	Н	со ₂ сн ₃	CH(C1)CH ₃	
	11	CH ₃	CH ³	Н	coscH ₃	сн(с1)сн ₃	
	12	CH ₃	сн3	H	CN	CH(CI)CH3	
	13	CH ₃	CH ₃	H	CO ² CH ³	CH2-CH2CI	Öl.
0.5	14	CH3	CH ₃	H	CO ² CH ³	CH2-CH2-CH2CI	•
25	15 16	CH ₃	CH ₃	H	CO ₂ CH ₃	CHC1 ₂	
	17	CH ³	с ₂ н ₅	H	CO ² CH ³	CHC12	
	18	CH ₃	CH ₃	H	CO ₂ C ₂ H ₅	CHC12	
	19	CH ₃	CH ³	H	CO21-C3H7	CHC1 ²	
30	20	CH ₃	CH ₃	H	COSCH ³	CHC12	
30		CH ₃	CH ₃	H	co ⁵ cH ⁵	CC1 3	
	21	CH ₃	сн ₃	Н	со ₂ сн ₃	CH=CH2	92
	22	CH ₃	CH ₃	H	CO2CH3	C≡CH	
	23	CH ₃	CH3	Н	co ² cH ³	C=CH ₂	90 ·
35	24	CH ₃	CH ₃	Н	со2сн3	С=СН ₂	
	L	J	J		۷ ع	Cl	į.

- 17 -

	Wirkstoff- Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Fp 7 (°C) oder n20
5	25 26 27	CH ₃ CH ₃ CH ₃	CH ₃ CH ₃ CH ₃	н н н	со ₂ сн ₃ со ₂ с ₂ н ₅ со ₂ сн ₃	CH=CCl ₂ CCl=CCl ₂	106
10	28	CH3	с ₂ н ₅	Н	co ₂ cH ₃	\triangleleft	
10	29	^С 2 ^Н 5	с ₂ н ₅	Н	со ₂ сн ₃	\triangleleft	
	30	CH ₃	н	3-CH ₃	со ₂ с ₂ н ₅	\triangleleft	
15	31	сн3	Н	5-CH ₃	co ₂ c ₂ H ₅	\triangleleft	
	32	сн3	Н	5-C1	co ₂ cH ₃	\triangleleft	
20	33	сн3	сн3	Н	coscH ₃	\triangleleft	
20	34	CH ₃	сн3	Н	со ₂ сн ₃		
	35	сн ₃	сн ₃	,H	со ₂ сн ₃	$\langle H \rangle$	
25	36	с ₂ н ₅	^С 2 ^Н 5	Н	co ₂ cH ₃	$\langle H \rangle$.viskos.
30	37 38 39 40	CH2	CH ₂	6-CH ₂	со ₂ сн ₃ со ₂ сн ₃ со	CHOCH	74-76.
	41 42	CHZ	CH ₃	Н	CO ₂ C ₂ H ₅ CO ₂ 1-C ₃ H ₇	сн осн з	86
	43 44	CH ₃	CH ₃	H	co-scH ₃	CH2OCH2	118
35	45 46	CH ₃	H H	4-C1	co ² cH ³	CH ² OCH ³	اد
		ر		7-0n3(O CO2CH3	CH2OCH3	

BASF	Aktiengesellschaft
------	--------------------

- 13 -

	Wirkstoff- Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Fp (°C) oder nD
5	47	CH ₃	CH ₃	Н	CO2CH3	CH2SCH3	
	48 49	CH ₃	с ₂ н ₅	H	CO ² CH ³	CH ² SCH ³	
	4 9 50	C ₂ H ₅	C2H ₅	H	CO2CH3	CH2SCH3	
	51	CH ₃	CH ³	H H	COSCH ₃	CH ₂ SCH ₃	
10		_	•	n	со ₂ сн ₃	CH ₂ -CN	
,0	52	CH ₃	CH ₃	H	coscH ₃		
	53	CH ₃	сн ₃	H	CO2CH3		136
	54	CH3	CH3	Н	CN		
15	55 ·	CH ₃	CH ³	Н	co ⁵ cH ³	- ()	117
	56	CH ₃	CH ₃	Н	co ² cH ³	- ()-F	145
20	57	CH3	CH ₃	Н	co ² cH ³	-© 61	81
25	58	CH ₃	CH3.	Н	со ₂ сн ₃	-© _{c1}	98-101
23	59	CH3	сн ³	Н	CO ₂ CH ₃	- ()-c1	161
	60	CH3	CH ³	Н	CO ₂ CH ₃	-©-c1	90
30	61	CH ₃	Н	5-CH ₃	со ² сн ³		
35	62	CH3	сн3	Н	coscH ₃	-©-c1	
	L.					•	

84	SF Aktiengesel	Ischaft	!	- 19	-		0012428 0.z. 0050/033581 R ⁵ Fp (°C) oder		
	Wirkstoff- Nr.	R ¹	R ²	5 _۾	R ⁴	R ⁵	(°C)		
5	63	CH ₃	CH3	Н	co ² cH ³	-©_c1	139		
	64	CH ₃	CH ₃	. Н	со ₂ сн ₃	-©			
10	65	CH3	CH3	Н	со ⁵ сн ³	-©-cF ₃			
	66	С ₂ Н ₅	C ₂ H ₅	Н	co ⁵ cH ³	-© _{CN}			
15	67	CH ₃	CH ₃	Н	co ² cH ³	-O	105-106		
	68	СН ₃	CH ³	Н	co ₂ cH ₃	-© CH ³	125-27		
20	69	CH ₃	CH3	Н	CO2CH3	-@≻cн3	117-119		
	70	CH ₃	CH3	Н	со ₂ сн ₃	-© och ₃	·		
25	71	CH ₃	CH ₃	Н	со ² сн ³	-© NO ₂			
30	72	CH ₃	CH ₃	Н	CO ₂ CH ₃	-© по ⁵	132-133		
	73		,		со ₂ сн ₃	NO ₂			
	74	CH ₃	CH3	Н	со ₂ сн ₃	-{\bar{\bar{\bar{\bar{\bar{\bar{\bar	115-116		
3 5	75 •	CH ₃	CH3	Н	со ₂ сн ₃	_(S)			

BNSDOCID: <EP__0012428A1_I_>

- 20 -

	Wirkstoff- Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	_R 5	Fp (°C) oder 20 nD
5	76	CH3	с ₂ н ₅	Н	со ₂ с ₂ н ₅	(s)	
	77	CH ₃	CH3	Н	co ² cH ³	\[\sum_{\subseteq} \]	121
10	78	CH ₃	CH ³	Н	co ₂ cH ₃	-(S)-c1	
	79	CH3	CH ₃	Н	co ² cH ³	C1	130-32
15	80	CH3	CH3	Н	co ₂ cH ₃		96-98
	81	CH ₃	^С 2 ^Н 5	Н	co ₂ c ₂ H ₅		81
20	82	CH ₃	сн3	Н	coscH ₃		121
25	83	СН 3	Сн3 -	Н	CN		
23	84	CH ₃	Н	5-CH ₃	co ² cH ³		
30	8 ₅	с ₂ н ₅	^C 2 ^H 5	Н	co ² cH ³		101-103
50	86	CH ₃	CH3	CH3	co ² cH ³		
35	87	CH3	CH ₃	Н	^{CO} 2 ^C 2 ^H 5		Öl

BNSDOCID: <EP__0012428A1_I_>

- 21 -

	Wirkstoff- Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Fp (°C) oder nD
5	88	CH ₃	CH3	Н	^{CO} 2 ^{1-C} 3	H ₇ —	
	89	CH3	сн3	Н	co ₂ cH ₃	-Br	
10	90	CH3	CH3	Н	co ² cH ³	CH ₃ O CH ₃	126-28
15	91	CH3	сн3	Н	co ² cH ³	$\langle \rangle$	
	92	CH3	CH3	Н	co ₂ cH ₃	-(N	
20	93	CH ₃	CH3	Н	co ₂ cH ₃	CH3 / N	122
	94	CH ₃	CH3	Н	co ⁵ cH ³	√oN cH3	106-08
25	95	CH3	CH3	Ĥ	со ₂ сн3	√s"y	
	96	CH3	Н	4-C1	CO ₂ CH ₃		
30	97	сн3	Н	Н	co ₂ cH ₃		
	98	Н	CH3	3-C1	со ₂ сн ₃		
35	99	Н	Cl	Н	co ² cH ³		
	L					•	

BNSDOCID: <EP___0012428A1_I_>

	Wirkstoff- Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Fp (°C) oder n20 nD
5	100	CH ₃	Н	5-C1	CO ² CH ³	CH2OCH3	95
	101	CH ₃	Н	H	CO ² CH ³	снзоснз	90
	102	H	Cl	H	CO ² CH ³	сносно	
	103	CH ₃	с ₂ н ₅	H	со ₂ сн ₃	сн ² осн ³	1,5261
	104	CH ₃	с ₂ н ₅	H	CO2C2H2	сносна	1,5210
10	105	CH ₃			CO2CH3	сн ₂ осн ₃	98
	106	CH ₃	H 5-t	•C4H9	CO2CH3	сн2осн3	1,5130
	107	CH ₃	CH3	Н	со ₂ сн ₃	CH2-CH2OCH3	Öl
	108	CH ₃	CH3	Н	co ₂ c ₂ H ₅	CH2-CH2OCH3	Öl
	109	CH ₃	CH ₃	Н	CO ² CH ³	CH(CH3)OCH3	Öl
15	110	CH ₃	CH ³	H	CO2C2H5	CH(CH3)OCH3	84-86
	111	CH ₃	CH ₃		2CH2CH=CH2	CH2OCH3	Öl
	112	CH ₃	CH ₃	H CO	CH ² CH=CH ²		
	113	CH3	CH ₃	H	CO ² CH ³	CH2C1	125-28
20	114	CH3	C2H5	H	CO ² CH ³	CH ₂ C1	61-63
	115	CH ₃	CH ₃	Н	CO ₂ C ₂ H ₅	CH ₂ C1	93-95
	116	CH ₃	сн ₃	Н	co ² cH ₃	CH ₂ -CH ₂ -F	,,,,
	117	сн 3	сн ₃	Н	co ² cH ³	~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~	
25	118	CH ₃	CH ₃	н	co ₂ cH ₃	O -CH3	
30	119	CH 3	CH3	Н	co ₂ cH ₃	N-N S-CH ₃	
	120	CH3	CH ₃	Н	co ² cH ³	N-N X S	·
35	121	CH ₃	сн3	Н	со ⁵ сн ³	N-N S-C1	
	L						

O.Z. 0050/033581

5	122	сн ₃ сн ₃	Ħ	_{ಲಂ²೦ಇ} 3	C1	143-144
	123	сн ³ сн ³	Н	co ₂ c ₂ =5	$\overline{\Diamond}$	110
	124	сн ₃ сн ₃	H	со ⁵ сн ³	-⊘	136
10	125	сн ₃ сн ₃	н	co ² c ⁵ H ²	—————————————————————————————————————	123-24
	126	сн ³ сн ³	н	co ² c ² н ²	₩C -{○}-	3 95 - 97
15	127	он ³ сн ³	Н	^{೮೦} 2 ^೮ 2 ^೮ 5	(E)	193
	128 .	сн ³ сн ³	ü	со ⁵ сн ³		43 102-04
20	129	сн ₃ сн ₃	Н	co ² cH ³	→ ○ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \	105-06
	130	сн ³ сн ³	н	со ² сн ³	→ O CF.	108-09
25	131	CH ₃ CH ₃	e H	co ² cH ³	-©,	, 145-47 I
	132	сн ³ сн ³	н	со ⁵ сн ³	ск ₂ ос ₂ н ₅	76-78
	133	сн _{3 сн} 3	н	со ₂ с ₂ н ₅	ся ₂ ос ₂ я ₅	79
30	134	сн ₃ сн ₃	н	со ⁵ ся ³		31
	135	сн ₃ сн ₃	A	co ₂ c ₂ н ₅		64-63
	136	сн ₃ сн ₃	к	со2сн3		99
35					0	

BNSDOCID: <EP__0012428A1_I_>

. ...

5

10

15

o.z. 0050/033581

Die neuen Wirkstoffe werden beispielsweise in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen, auch hochprozentige wäßrige, ölige oder sonstige Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln, Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet. Die Anwendungsformen richten sich ganz nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der neuen Wirkstoffe gewährleisten.

Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten und Öldispersionen kommen Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle usw., sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, zum Beispiel Benzol, Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Waphthaline oder deren Derivate zum Beispiel Methanol, Athanol, Propanol, Butanol, Chloroform, Tetra-20 chlorkohlenstoff, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Chlorbenzol, Isophoron usw., stark polare Lösungsmittel, wie z.B. Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon, Wasser usw. in Betracht.

25 Wäßrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten oder netzbaren Pulvern (Spritzpulvern), Öldispersionen durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substanzen als solche oder in einem öl oder Lösungsmittel 30 gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz, Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder 51 bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung 35 mit Wasser geeignet sind.

Als oberflächenaktive Stoffe kommen in Betracht: Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäuren, Phenolsulfonsäure, Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Alkali- und Erdalkalisalze der Dibutynaphthalinsulfonsäure, Lauryläthersulfat, Fettalkoholsulfate, fettsaure Alkali- und Erdalkalisalze, Salze sulfatierter Hexadecanole, Heptadecanole, Octadecanole, Salze von sulfatiertem Fettalkoholglykoläther, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Konden-10 sationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäuren mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyäthylen--octylphenoläther, äthoxyliertes Isooctylphenol-, Octylphenol-, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykoläther, Tributylphenylpolyglykoläther, Alkalarylpolyätheralkohole, 15 Isotridecylalkohol, Fettalkoholäthylenoxid-Kondensate, äthoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyäthylenalkyläther, äthoxyliertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykolätheracetal, Sorbitester, Lignin, Sulfitablaugen und Methyl-20 cellulose.

Pulver, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

25

30

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind z.B. Mineralerden wie Silicagel, Kieselsäuren, Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Atteclay, Kalkstein, Kreide, Talkum, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calciumund Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie z.B. Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie

O.Z. 0050/033581

Getreidemenle, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver und andere feste Trägerstoffe.

Die neuen Wirkstoffe zeigen eine starke fungitoxische Wirksamkeit gegen phytopathogene Pilze, insbesondere aus der 5 Klasse der Phycomyceten. Die neuen Verbindungen sind daher beispielsweise geeignet zur Bekämpfung von Phytophthora infestans an Tomaten und Kartoffeln, Phytophthora parasitica an Erdbeeren, Phytophthora cyctorum an Äpfeln, Pseudoperonospora cubensis an Gurken, Pseudoperonospora humuli an 10 Hopfen, Peronospora destructor an Zwiebeln, Peronospora sparsa an Rosen, Peronospora tabacina an Tabak, Plasmopara viticola an Reben, Plsmopara halstedii an Sonnenblumen, Sclerospora macrospora an Mais, Bremia lactucae an Salat, 15 Mucor mucedo an Früchten, Rhizopus nigricans an Rüben. Die fungiziden Mittel enthalten 0,1 bis 95 % (Gewichtsprozent) Wirkstoff, vorzugsweise 0,5 bis 90 %. Die Aufwandmengen liegen je nach Art des gewünschten Effektes zwischen 0,1 und 5 kg Wirkstoff je ha. Ein Teil der Wirkstoffe 20 zeigt kurative Eigenschaften, d.h. die Anwendung der Mittel kann noch nach erfolgter Infektion der Pflanzen durch die Krankheitserreger vorgenommen werden, um einen sicheren Bekämpfungserfolg zu erzielen. Darüberhhinaus sind viele der neuen Verbindungen systemisch wirksam, so daß über die Wur-25 zelbehandlung auch ein Schutz oberirdischer Pflanzenteile möglich ist.

Ferner lassen sich mit den neuen Verbindungen auch Pilze, die Keimlings- und Auflaufkrankheiten hervorrufen, beispielsweise Pythium- und Aphamomyces-Arten an Leguminosen und Baumwolle, bekämpfen. Die Aufwandmengen betragen je 100 kg Saatgut 10 bis 200 g Wirkstoff; die Anwendung erfolgt in Form von Saatgutbeizmitteln.

. 30

. **0. Z**. 0050/033581

Die neuen Wirkstoffe können auch zusammen mit anderen Wirkstoffen, z.B. Herbiziden, Insektiziden, Wachstumsregulatoren und Fungiziden oder auch mit Düngemitteln vermischt und ausgebracht werden. In vielen Fällen erhält man bei der Mischung mit Fungiziden eine Vergrößerung des fungiziden Wirkungsspektrums; bei einer Anzahl dieser Fungizidmischungen treten auch synergistische Effekte auf, d.h. die fungizide Wirksamkeit des Kombinationsproduktes ist größer als die der addierten Wirksamkeiten der Einzelkomponenten. Eine besonders günstige Vergrößerung des Wirkungsspektrums wird mit folgenden Fungiziden erzielt:

Manganäthylenbisdithiocarbamat

- Mangan-Zinkäthylenbisdithiocarbamat
 Ammoniak-Komplex von Zink-(N,N-äthylen-bis-dithiocarbamat)
 N-Trichlormethylthio-tetrahydrophthalimid
 N-Trichlormethyl-phthalimid
 5-Athoxy-3-trichlormethyl-1,2,3-thiadiazol
 20 2-Methoxycarbonylamina banai ill
- 2-Methoxycarbonylamino-benzimidazol
 2-Rhodanmethylthiobenzthiazol
 1,4-Dichlor-2,5-dimethoxybenzol
 2,3-Dichlor-6-methyl-1,4-oxathiin-5-carbonsäureanilid
 2-Methyl-5,6-dihydro-4-H-pyran-3-carbonsäure-anilid
- 25 2,4,5-Trimethyl-furan-3-carbonsäureanilid
 2-Methyl-furan-3-carbonsäureanilid
 2,5-Dimethyl-furan-3-carbonsäurecyclohexylamid
 N-Cyclohexyl-N-methoxy-2,5-dimethyl-furan-3-carbonsäure-amid
- 5-Methyl-5-vinyl-3-(3,5-dichlorphenyl)-2,4-dioxo-1,3-oxazolidin
 5-Methyl-5-methoxymethyl-3-(3,5-dichlorphenyl)-2,4-dioxo-1,3-oxazolidin-N-p-Fluorphenyl-2,3-dichlormaleinimid

0.2. 0050/035581

Die folgende Liste von Fungiziden, mit denen die erfindungs- a gemäßen Verbindungen kombiniert werden können, soll die Kombinationsmöglichkeiten erläutern, nicht aber einschränken.

5

Fungizide, die mit den erfindungsgemäßen Wirkstoffen kombiniert werden können, sind beispielsweise:

Dithiocarbamate und deren Derivate, wie

Ferridimethyldithiocarbamat,
Zinkdimethyldithiocarbamat,
Zinkäthylenbisdithiocarbamat,
Tetramethylthiuramidsulfide,
Zink-(N,N-propylen-bis-dithiocarbamat),

Ammoniak-Komplex von Zink(N,N'-propylen-bis-dithiocarbamat) und

N,N'-Polypropylen-bis-(thiocarbamoyl)-disulfid;

Nitroderivate, wie

Dinitro-(1-methylheptyl)-phenylcrotonat, 2-sec-Butyl-4,6-dinitrophenyl-3,3-dimethylacrylat, 2-sec-Butyl-4,6-dinitrophenyl-isopropylcarbonat;

heterocyclische Strukturen, wie

2-Heptadecyl-2-imidazolin-acetat, 2,4-Dichlor-6-(o-chloranilino)-s-triazin, 0,0-Diäthyl-phthalimidophonothioat, 5-Amino-1-(bis-(dimethylamino)-phosphinyl)-3-phenyl-1,2,4--triazol),

2,3-Dicyano-1,4-dithiaanthrachinon,
2-Thio-1-1,3-dithio-(4,5-b)-chinoxalin,
1-(Butylcarbamoyl)-2-benzimidazol-carbaminsäuremethyl-ester,
4-(2-Chlorphenylhydrazono)-3-methyl-5-isocazolon,
Pyridin-2-thio-1-oxid,

0.2. 0050/033581

8-Hydroxychinolin bzw. dessen Kupfersalz,

- 2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin-4,4-dioxid
- 2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methỳl-1,4-oxathiin,
- 2-(Furyl-(2))-benzimidazol,
- 5 Piperazin-1,4-diylbis-(1-(2,2,2-trichlor-athyl)-formamid, 2-(Thiazolyl-(4)-benzimidazol.
 - 5-Butyl-2-dimethylamino-4-hydroxy-6-methyl-pyrimidin, Bis-(p-Chlorphenyl)-3-pyridinmethanol,
 - 1,2-Bis-(3-äthoxycarbonyl-2-thioureido)-benzol,
- 1,2-Bis-(3-methoxycarbonyl-2-thioureido)-benzol, sowie verschiedene Fungizide, wie

Dodecylguanidinacetat,

- 3-(3-(3,5-Dimethyl-2-oxycyclohexyl)-2-hydroxyäthyl)-gluarimid, Hexachlorbenzol,
- N-Dichlorfluormethylthio-N!N'-dimethyl-N-phenyl-schwefelsäurediamid,
 - 2,5-Dimethyl-furan-3-carbonsäureanilid,
 - 2-Methyl-benzoesäure-anilid,
 - 2-Jod-benzoesäure-anilid,
- 20 1-(3,4-Dichloranilino)-1-formylamino-2,2,2-trichlorathan,
 - 2,6-Dimethyl-N-tridecyl-morpholin bzw. dessen Salze,
 - 2,6-Dimethyl-N-cyclododecyl-morpholin bzw. dessen Salze.

 - 1-(4-Chlorphenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-2-
- 25 butanon
 - 1-(4-Chlorphenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-2-butanol

Die folgenden Beispiele erläutern die fungizide Wirkung der Verbindungen. Als Vergleichssubstanzen werden in den Beispielen folgende bekannte fungizide Verbindungen angeführt:

0 0 C₂H₅-NH-C-NH-C-C-CN 35 Verbindung A NO-CH₃ 0 "N-scc1,

5

Verbindung B

Beispiel 4

10 Fungizide Wirksamkeit gegen Phytophthora infestans an Tomaten.

Blätter von Tomatenpflanzen der Sorte "Professor Rudloff" werden mit wäßrigen Suspensionen, die 80 % (Gewichtsprozent) des zu prüfenden Wirkstoffes und 20 % Natriumligninsulfonat in der Trockensubstanz enthalten, besprüht. Es werden 0,025 und 0,012 %ige Spritzbrühen (berechnet auf die Trockensubstanz) verwendet. Nach dem Antrocknen des Spritzbelages werden die Blätter mit einer Zoosporenaufschwemmung des Pilzes Phytophthora infestans infiziert. Die Pflanzen werden dann in einer wasserdampfgesättigten, jedoch infizierten Kontrollpflanzen so stark entwickelt, daß die fungizide Wirksamkeit der Substanzen beurteilt werden kann:

25

15

20

30

35

BNSDOCID: <EP___0012428A1_I_>

0 = kein Pilzbefall, abgestuft bis 5 = Totalbefall (Kontrolle)

Wirkstoff	Befall der Blätter nach Spritzung mit %iger Wirkstoffbrühe				
	0,025	0,012			
37	0	1			
56	0	0.			
74	0	0			
80	0	. 1			
A (bekannt)	. 5	1			
Kontrolle (unbehandelt)		5			
	37 56 74 80 A (bekannt)	74 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0			

Beispiel 5

Fungizide Wirksamkeit gegen Plasmopara viticola an Reben

20 Blätter von Topfreben der Sorte Müller-Thurgau werden mit einer Zoosporenaufschwemmung des Pilzes Plasmopara viticola infiziert. Die Pflanzen kommen dann für 16 Stunden in eine wasserdampfgesättigte (feuchte) Kammer bei 24°C. Während dieser Zeit erfolgt die Infektion des Blattgewebes. Da-25 nach werden die Pflanzen zur Ermittlung der kurativen Wirksamkeit mit wäßrigen Suspensionen, die 80 % (Gewichtsprozent) des zu prüfenden Wirkstoffes und 20 % Natriumligninsulfonat in der Trockensubstanz enthalten, besprüht. Es werden 0,05 % Spritzbrühen (bezogen auf die Trockensub-30 stanz) verwendet. Nach der Wirkstoffanwendung werden die Reben 8 Tage im Gewächshaus zwischen 22 und 24°C aufgestellt. Nach dieser Zeit werden die Pflanzen zur Beschleunigung und Verstärkung des Sporangienträgerausbruches abermals während 16 Stunden in der feuchten Kammer 35 aufgestellt. Dann wird eine Beurteilung des Krankheitsausbruches vorgenommen.

O = kein Pilzbefall, abgestuft bis 5 = Totalbefall (Kontrolle)

5	Wirkstoff	Befall der Blätter nach Spritzung mit 0,05 %iger Wirkstoffbrühe
	1	0
	8	0
	9	0
	27	0
10	36	•
	37	0 _. 0
	53	
	80	0
	85	0
15		0
.5	A (bekannt)	2–3
	Kontrolle (unbehandelt	5

20 Beispiel 6

Fungizide Wirksamkeit gegen Auflaufkrankheiten an Erbsen

100-g-Proben Erbsensamen der Sorte "Senator" werden in Glasflaschen etwa 5 Minuten lang mit 300 mg (= 0,3 Gew.-%) Beizmittelaufbereitungen, die 40 % Wirkstoff und 60 % Ton in der Trockensubstanz enthalten, sorgfältig geschüttelt. Danach werden jeweils 100 Samen in Saatkisten 3 cm tief und mit einem Abstand von 3 bis 5 cm in eine Komposterde eingesät, die eine starke natürliche Verseuchung mit den Pilzen Pythium spec., Aphanomyces spec. und Fusarium oxysporum aufweist. Die Kästen werden im Gewächshaus bei Temperaturen von 17 bis 20°C aufgestellt. Nach einer Versuchsdauer von 21 Tagen wird die Anzahl gesunder Erbsenpflanzen ermittelt.

O.Z. 0050/033581

		% gesunde Pflanzen nach 21 Tagen n Komposterde
	7 4	90
	B (bekannt)	60
5	Kontrolle (unbehandelt)	10
	Kontrolle sterilisierte Komposter	rde 93

Beispiel 7

10

Man vermischt 90 Gewichtsteile der Verbindung 1 mit 10 Gewichtsteilen N-Methyl- -pyrrolidon und erhält eine Mischung, die zur Anwendung in Form kleinster Tropfen geeignet ist.

15

Beispiel 8

20 Gewichtsteile der Verbindung 2 werden in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen Xylol, 10 Gewichtsteilen 20 des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol äthylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoäthanolamid, 5 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 5 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Äthylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Ausgießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gewichtsprozent des Wirkstoffs enthält.

Beispiel 9

30

35

20 Gewichtsteile der Verbindung 3 werden in einer Mischung gelöst, die aus 40 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 30 Gewichtsteilen Isobutanol, 20 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Athylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Athy-

O.Z. 0050/033581

Tenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gewichtsprozent des Wirkstoffs enthält.

5

Beispiel 10

20 Gewichtsteile der Verbindung 1 werden in einer Mischung gelöst, die aus 25 Gewichtsteilen Cyclohexanol, 65 Ge10 wichtsteilen einer Mineralölfraktion vom Siedepunkt 210 bis 280°C und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Äthylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gewichtsprozent des Wirkstoffs enthält.

Beispiel 11

20 Gewichtsteile des Wirkstoffs 2 werden mit 3 Gewichts20 teilen des Natriumsalzes der Diisobutylnaphthalin- -sulfonsäure, 17 Gewichtsteilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60 Gewichtsteilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und
in einer Hammermühle vermahlen. Durch feines Verteilen
der Mischung in 20 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man
eine Spritzbrühe, die 0,1 Gewichtsprozent des Wirkstoffs
enthält.

Beispiel 12

30

3 Gewichtsteile der Verbindung 3 werden mit 97 Gewichtsteilen feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 3 Gewichtsprozent des Wirkstoffs enthält.

Beispiel 13

30 Gewichtsteile der Verbindung 4 werden mit einer Mischung aus 92 Gewichtsteilen pulverförmigem Kieselsäuregel und 8 Gewichtsteilen Paraffinöl, das auf die Oberfläche dieses Kieselsäuregels gesprüht wurde, innig vermischt. Man erhält auf diese Weise eine Aufbereitung des Wirkstoffs mit guter Haftfähigkeit.

10 Beispiel 14

40 Gewichtsteile des Wirkstoffs 1 werden mit 10 Teilen Natriumsalz eines Phenolsulfonsäure-harnstoff-formalde-hyd-Kondensats, 2 Teilen Kieselgel und 48 Teilen Wasser innig vermischt. Man erhält eine stabile wäßrige Dispersion. Durch Verdünnen mit 100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,04 Gewichtsprozent Wirkstoff enthält.

20 <u>Beispiel 15</u>

20 Teile des Wirkstoffs 2 werden mit 2 Teilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure, 8 Teilen Fettalkohol-poly-glykoläther, 2 Teilen Natriumsalz eines Phenolsulfonsäure-harnstoff-formaldehyd-Kondensats und 68 Teilen eines paraffinischen Mineralöls innig vermischt. Man erhält eine stabile ölige Dispersion.

Sus

30

Patentansprüche

Substituierte Cyanamide der allgemeinen Formel

$$\begin{array}{c|c}
R^{1} & & \\
& & \\
& & \\
R^{3} & & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
& & \\
&$$

10 in welcher R^1 C_1 - C_4 Alkyl oder C_1 - C_4 -Alkoxy, R^2 Wasserstoff, C_1 - C_4 Alkyl, C_1 - C_4 Alkoxy oder Halogen, R^3 Wasserstoff, C_1 - C_4 -Alkyl oder Halogen, R^4 C_1 - C_6 -Alkoxcarbonyl, C_3 - C_4 -Alkenoxycarbonyl, 15 C1-C6-Alkyl-thiocarbonyl oder Cyan und R⁵ ein gegebenenfalls durch niederes Alkoxy, Alkylthio, Cyan oder Halogen substituiertes C₁-C₆ Alkyl, ein gegebenenfalls durch Halogen substituiertes $^{\rm C}2^{-\rm C}5$ Alkenyl, ein $^{\rm C}2^{-\rm C}4$ Alkinyl, ein C3C7 Cycloalkyĺ, einen gegebenenfalls 20 durch niederes Alkyl oder Halogen substituierten heterocyclischen Rest bedeutet, der ein Sauerstoffatom oder ein Schwefelatom oder ein Stickstoffatom oder bis zu zwei Stickstoffatome und ein Sauerstoffatom oder bis zu zwei Stickstoffatome und ein Schwefelatom 25 enthält, R⁵ ferner ein Phenyl oder ein durch ein bis drei gleiche oder verschiedene Substituenten aus der Gruppe Fluor, Chlor, Brom, Trifluormethyl, Cyan, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄ Alkoxy substituiertes Phenyl 30 bedeutet.

7. Fungizid, enthaltend ein substituiertes Cyanamid der allgemeinen Formel

$$R^{3} \xrightarrow{\mathbb{R}^{2}} \mathbb{C}^{H_{2}-N} \xrightarrow{\mathbb{C}^{R}^{4}} \mathbb{C}^{N}$$

in welcher

10

 R^1 C_1 - C_4 Alkyl oder C_1 - C_4 -Alkoxy, R^2 Wasserstoff, C_1 - C_4 Alkyl, C_1 - C_4 Alkoxy oder Halogen,

R3 Wasserstoff, C1-C4-Alkyl oder Halogen,

R4 C1-C6-Alkoxcarbonyl, C3-C4-Alkenoxycarbonyl,

C1-C6-Alkyl-thiocarbonyl oder Cyan und

R⁵ ein gegebenenfalls durch niederes Alkoxy, Alkylthio, Cyan oder Halogen substituiertes C1-C6

Alkyl, ein gegebenenfalls durch

Halogen substituiertes C_2-C_5 Alkenyl, ein C_2-C_4 Alkinyl, ein C₃C₇ Cycloalkyĺ, einen gegebenenfalls

durch niederes Alkyl oder Halogen substituierten heterocyclischen Rest bedeutet, der ein Sauerstoffatom oder ein Schwefelatom oder ein Stickstoffatom oder bis

zu zwei Stickstoffatome und ein Sauerstoffatom oder bis zu zwei Stickstoffatome und ein Schwefelatom

25 enthält, R⁵ ferner ein Phenyl oder ein durch ein bis drei gleiche oder verschiedene Substituenten aus der Gruppe Fluor, Chlor, Brom, Trifluormethyl, Cyan,

Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄ Alkoxy substituiertes Phenyl

bedeutet.

30

15

3. Fungizid, enthaltend einen festen oder flüssigen Träger1 stoff und ein substituiertes Cyanamid der allgemeinen Formel

5

15

10 in welcher

 R^1 C_1 - C_4 Alkyl oder C_1 - C_4 -Alkoxy, R^2 Wasserstoff, C_1 - C_4 Alkyl, C_1 - C_4 Alkoxy oder Halogen, R^3 Wasserstoff, C_1 - C_4 -Alkyl oder Halogen,

R⁴ C₁-C₆-Alkoxcarbonyl, C₃-C₄-Alkenoxycarbonyl,

C₁-C₆-Alkyl-thiocarbonyl oder Cyan und

R⁵ ein gegebenenfalls durch niederes Alkoxy, Alkylthio, Cyan oder Halogen substituiertes C₁-C₆

Alkyl, ein gegebenenfalls durch

Halogen substituiertes $^{\rm C}_2$ - $^{\rm C}_5$ Alkenyl, ein $^{\rm C}_2$ - $^{\rm C}_4$ 20

Alkinyl, ein C₃C₇ Cycloalkyĺ, einen gegebenenfalls durch niederes Alkyl oder Halogen substituierten

heterocyclischen Rest bedeutet, der ein Sauerstoffatom oder ein Schwefelatom oder ein Stickstoffatom oder bis

zu zwei Stickstoffatome und ein Sauerstoffatom oder

bis zu zwei Stickstoffatome und ein Schwefelatom 25

enthält, R⁵ ferner ein Phenyl oder ein durch ein bis drei gleiche oder verschiedene Substituenten aus der

Gruppe Fluor, Chlor, Brom, Trifluormethyl, Cyan,

Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄ Alkoxy substituiertes Phenyl

30 bedeutet.

4. Verfahren zur Herstellung eines Fungizids, dadurch gekennzeichnet, daß man einen festen oder flüssigen Trägerstoff vermischt mit einem substituierten Cyanamid der allgemeinen Formel

5

$$\begin{array}{c|c}
R^{1} & & \\
R^{2} & & \\
R^{2} & & \\
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
CH_{2}-N \\
CO-R^{5}
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
R^{4} \\
CN
\end{array}$$

10

15

in welcher

R¹ C₁-C₄ Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy,

R² Wasserstoff, C₁-C₄ Alkyl, C₁-C₄ Alkoxy oder Halogen,

R³ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder Halogen,

R⁴ C₁-C₆-Alkoxcarbonyl, C₃-C₄-Alkenoxycarbonyl,

C₁-C₆-Alkyl-thiocarbonyl oder Cyan und

R⁵ ein gegebenenfalls durch niederes Alkoxy, Alkylthio, Cyan oder Halogen substituiertes C1-C6 Alkyl, ein gegebenenfalls durch

Halogen substituiertes C_2 - C_5 Alkenyl, ein C_2 - C_4 20 Alkinyl, ein C3C7 Cycloalkyí, einen gegebenenfalls durch niederes Alkyl oder Halogen substituierten heterocyclischen Rest bedeutet, der ein Sauerstoffatom oder ein Schwefelatom oder ein Stickstoffatom oder bis

zu zwei Stickstoffatome und ein Sauerstoffatom oder 25 bis zu zwei Stickstoffatome und ein Schwefelatom enthält, R^5 ferner ein Phenyl oder ein durch ein bis drei gleiche oder verschiedene Substituenten aus der Gruppe Fluor, Chlor, Brom, Trifluormethyl, Cyan,

Nitro, C_1 - C_4 - Alkyl, C_1 - C_4 Alkoxy substituiertes Phenyl 30 bedeutet.

5. Verfahren zur Bekämpfung von Pilzen, dadurch gekennzeichnet, daß man die Pilze oder die vor Pilzbefall
zu schützenden Gegenstände behandelt mit einem substituierten Cyanamide der allgemeinen Formel

5

10

in welcher

R¹ C₁-C₄ Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy,

R² Wasserstoff, C₁-C₄ Alkyl, C₁-C₄ Alkoxy oder Halogen,

R³ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder Halogen,

R⁴ C₁-C₆-Alkoxcarbonyl, C₃-C₄-Alkenoxycarbonyl,

C₁-C₆-Alkyl-thiocarbonyl oder Cyan und

R⁵ ein gegebenenfalls durch niederes Alkoxy, Alkyl
thio, Cyan oder Halogen substituiertes C₁-C₆

Alkyl, ein gegebenenfalls durch

Halogen substituiertes C₂-C₅ Alkenyl, ein C₂-C₄

Alkinyl, ein C₃C₇ Cycloalkyl, einen gegebenenfalls

durch niederes Alkyl oder Halogen substituierten

heterocyclischen Rest bedeutet, der ein Sauerstoffatom

oder ein Schwefelatom oder ein Stickstoffatom oder bis

zu zwei Stickstoffatome und ein Sauerstoffatom oder

zu zwei Stickstoffatome und ein Stickstoffatom oder bi
zu zwei Stickstoffatome und ein Sauerstoffatom oder
bis zu zwei Stickstoffatome und ein Schwefelatom
enthält, R⁵ ferner ein Phenyl oder ein durch ein bis
drei gleiche oder verschiedene Substituenten aus der
Gruppe Fluor, Chlor, Brom, Trifluormethyl, Cyan,
Nitro.C.-C.-Alkyl, C.-C. Alkyl, C.-C. Alkyl

Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄ Alkoxy substituiertes Phenyl bedeutet.

5

15

20

25

30

Verfahren zur Herstellung eines substituierten Cyanamids der allgemeinen Formel

$$\begin{array}{c|c}
R^1 & CH_2-N < R^4 \\
CO-R^5 & CN
\end{array}$$

in welcher

R¹ C₁-C₄ Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy,

R² Wasserstoff, C₁-C₄ Alkyl, C₁-C₄ Alkoxy oder Halogen,

R³ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder Halogen,

R⁴ C₁-C₆-Alkoxcarbonyl, C₃-C₄-Alkenoxycarbonyl, C1-C6-Alkyl-thiocarbonyl oder Cyan und

R⁵ ein gegebenenfalls durch niederes Alkoxy, Alkylthio, Cyan oder Halogen substituiertes C₁-C₆ Alkyl, ein gegebenenfalls durch

Halogen substituiertes C_2-C_5 Alkenyl, ein C_2-C_4 Alkinyl, ein C₃C₇ Cycloalkyl, einen gegebenenfalls durch niederes Alkyl oder Halogen substituierten heterocyclischen Rest bedeutet, der ein Sauerstoffatom oder ein Schwefelatom oder ein Stickstoffatom oder bis zu zwei Stickstoffatome und ein Sauerstoffatom oder bis zu zwei Stickstoffatome und ein Schwefelatom enthält, R⁵ ferner ein Phenyl oder ein durch ein bis drei gleiche oder verschiedene Substituenten aus der Gruppe Fluor, Chlor, Brom, Trifluormethyl, Cyan, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄ Alkoxy substituiertes Phenyl

bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man ein Mol eines N-Halogenmethylanilids der Formel

$$R^{1}$$
 CH_{2}
 CH

in welcher R¹, R², R³ und R⁵ die oben angegebene Bedeutung haben und Hal Halogen, insbesondere Chlor oder Brom bedeutet, mit mindestens einem Mol eines Cyanamids der Formel

5

in welcher R⁴ die oben angegebene Bedeutung hat und M Wasserstoff, ein Alkalimetall oder einen Tetraalkylammonium-Rest bedeutet, bei einer Temperatur zwischen O und 150°C, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines gegenüber den Reaktionspartnern inerten Lösungsmittels umsetzt.

7. Substituierter Cyanamid, hergestellt gemäß dem vorhergehenden Patentanspruch.

20

8. Verfahren zur Herstellung eines substituierten Cyanamids der allgemeinen Formel

$$\begin{array}{c|c}
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\
 & & \\$$

30

R¹ C₁-C₄ Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy,

R² Wasserstoff, C₁-C₄ Alkyl, C₁-C₄ Alkoxy oder Halogen,

R³ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder Halogen,

R⁴ C₁-C₆-Alkoxcarbonyl, C₃-C₄-Alkenoxycarbonyl,

C₁-C₆-Alkyl-thiocarbonyl oder Cyan und

R⁵ ein gegebenenfalls durch niederes Alkoxy, Alkyl-

BNSOOCID: <EP___0012428A1_I_>

5

10

15

20

thio, Cyan oder Halogen substituiertes C₁-C₆
Alkyl, ein gegebenenfalls durch

Halogen substituiertes C₂-C₅ Alkenyl, ein C₂-C₄
Alkinyl, ein C₃C₇ Cycloalkyl, einen gegebenenfalls
durch niederes Alkyl oder Halogen substituierten
heterocyclischen Rest bedeutet, der ein Sauerstoffatom
oder ein Schwefelatom oder ein Stickstoffatom oder bis
zu zwei Stickstoffatome und ein Sauerstoffatom oder
bis zu zwei Stickstoffatome und ein Schwefelatom
enthält, R⁵ ferner ein Phenyl oder ein durch ein bis
drei gleiche oder verschiedene Substituenten aus der
Gruppe Fluor, Chlor, Brom, Trifluormethyl, Cyan,
Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄ Alkoxy substituiertes Phenyl
bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man ein Mol
eines N-Halogenmethylanilids der Formel

$$\begin{array}{c|c}
R^{3} & \stackrel{R^{1}}{\swarrow} \\
 & \stackrel{CH_{2}-Hal}{\swarrow} \\
 & \stackrel{CO-R^{5}}{\searrow}
\end{array}$$

in welcher R¹, R², R³ und R⁵ die oben angegebene Bedeutung haben und Hal Chlor oder Brom bedeutet, mit mindestens einem Mol eines Cyanamids der Formel

in welcher R⁴ die oben angegebene Bedeutung hat und M ein Alkalimetall bedeutet, bei einer Temperatur zwischen O und 150°C, in einem Zweiphasensystem, wobei die eine Phase Wasser und die andere Phase ein mit der wäßrigen Phase nicht mischbares gegenüber den Reaktionspartnern inertes Lösungsmittel ist, in Gegen-

- wart von 0,5 bis 30 Molprozent eines Phasentransfer-katalysators umsetzt.
- 9. Substituiertes Cyanamid, hergestellt gemäß dem vor-5 hergehenden Anspruch.
 - 10. Substituiertes Cyanamid, ausgewählt aus der Gruppe, bestehend aus N-Methoxycarbonyl-N-(N'-methoxyacetyl, N'-2',6'-dimethylanilinomethyl)-cyanamid
- N-Athoxycarbonyl-N-(N'-methoxyacetyl, N'-2',6'-dimethylanilinomethyl)-cyanamid
 N-Methoxycarbonyl-N-(N'-3-fluorbenzoyl,N'-2',6'-dimethylanilinomethyl)-cyanamid
 N-Methoxycarbonyl-N-(N'-4-fluorbenzoyl, N'-2',6'-di-
- methylanilinomethyl)-cyanamid
 N-Methoxycarbonyl-N-(N'-furo-2-yl N'-2',6'-dimethylanilinomethyl)-cyanamid
 N-Äthoxycarbonyl-N-(N'-furo-2-yl, N'-2',6'-dimethylanilinomethyl)-cyanamid
- N-Methoxycarbonyl-N-(N'-theno-2-yl, N'-2',6'-dimethyl-anilinomethyl)-cyanamid.
 - 11. Fungizid, enthaltend ein substituiertes Cyanamid, ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus
- N-Methoxycarbonyl-N-(N'-methoxyacetyl, N'-2',6'-di-methylanilinomethyl)-cyanamid
 N-Äthoxycarbonyl-N-(N'-methoxyacetyl, N'-2',6'-di-methylanilinomethyl)-cyanamid
 N-Methoxycarbonyl-N-(N'-3-fluorbenzoyl,N'-2',6'-di-
- methylanilinomethyl)-cyanamid
 N-Methoxycarbonyl-N-(N'-4-fluorbenzoyl, N'-2',6'-dimethylanilinomethyl)-cyanamid
 N-Methoxycarbonyl-N-(N'-furo-2-yl N'-2',6'-dimethylanilinomethyl)-cyanamid
- N-Athoxycarbonyl-N-(N'-furo-2-yl, N'-2',6'-dimethyl-anilinomethyl)-cyanamid

N-Methoxycarbonyl-N-(N'-theno-2-yl, N'-2',6'-dimethyl- anilinomethyl)-cyanamid.



EUROPÄISCHER RECHERCHENBERICHT

Nummier der Anmeldurig EF 79 10 5±08

A I	Kennzeichnung des Dokuments mit Angabe, soweit erforderlich, die maßgeblichen Teile DE - A - 1 643 527 (SHELL) Ansprüche *	1	C 07 C 125/08 155/02 C 07 D 307/68 333/38 A 01 N 47/40
F	DE - A - 1 643 527 (SHELL) * Ansprüche *	1	155/02 C 07 D 307/68 333/38
			333/38 A O1 N 47/40
			RECHERCHIERTE
	·		SACHGEBIETE (Int. Cl. 4)
			07 C 125/03 07 D 307/68
	-		
	r.	-	KATEGORIE DER GENANNTEN DOKUMENTE
		A: O.	von besonderer Bedeutung technologischer Hintergrund nichtschriftliche Offenbarun
		Τ:	Zwischeniteratur der Erfindung zugrunde liegende Theorien oder Grundsatze
	-	D:	kollicierende Anmerdung in der Anmeldung angeführte Dokument aus andern Gründen angeführtes Dokument
(Der vorliegende Recherchenbericht wurde für alle Patentansprüche erstel	8	Mitglied der gleichen Paterit- familie. ubereinstimmende
Den	Haag 24-03-1980	Profer	Dokument

THIS PAGE BLANK (USPTO)